

DE 19956185

3/3,AB,LS/1
DIALOG(R)File 351:Derwent WPI
(c) 2004 Thomson Derwent. All rts. reserv.

013915124

WPI Acc No: 2001-399337/ 200143

XRAM Acc No: C01-121599

Transparent antiperspirant emulsion contains addition products of
ethylene oxide and/or propylene oxide on linear 16-22C
hydroxy-substituted fatty alcohols as emulsifier

Patent Assignee: COGNIS DEUT GMBH (COGN-N)

Inventor: ANSMANN A; BRUENING S; LANG S

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

| Patent No | Kind | Date | Applicat No | Kind | Date | Week |
|-------------|------|----------|-------------|------|----------|----------|
| DE 19956185 | A1 | 20010523 | DE 1056185 | A | 19991122 | 200143 B |

Priority Applications (No Type Date): DE 1056185 A 19991122

Patent Details:

| Patent No | Kind | Lan | Pg | Main IPC | Filing Notes |
|-------------|------|-----|----|-------------|--------------|
| DE 19956185 | A1 | | 9 | A61K-007/00 | |

Abstract (Basic): DE 19956185 A1

Abstract (Basic):

NOVELTY - Transparent antiperspirant emulsion comprises 16-40 wt.%
emulsifiers from addition products of 2-30 molar ethylene oxide and/or
0-5 molar propylene oxide on linear 16-22C hydroxy-substituted fatty
alcohols, 5-45 wt.% oil components and 0-30 wt.% antiperspirant agents.

USE - For the preparation of transparent compositions of viscosity
above 10000 mPas (claimed).

ADVANTAGE - The antiperspirant and sensory properties are good with
minimal stickiness.

pp; 9 DwgNo 0/0



①⑨ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT

①⑫ **Offenlegungsschrift**
①⑩ **DE 199 56 185 A 1**

⑤① Int. Cl.⁷:
A 61 K 7/00
A 61 K 7/32

②① Aktenzeichen: 199 56 185.0
②② Anmeldetag: 22. 11. 1999
④③ Offenlegungstag: 23. 5. 2001

DE 199 56 185 A 1

⑦① Anmelder:
Cognis Deutschland GmbH, 40589 Düsseldorf, DE

⑦② Erfinder:
Brüning, Stefan, Dr., 40597 Düsseldorf, DE;
Ansmann, Achim, Dr., 40699 Erkrath, DE; Lang,
Susan, 52428 Jülich, DE

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

⑤④ Emulsionen

⑤⑦ Vorgeschlagen werden Emulsionen, enthaltend - bezo-
gen auf die Endkonzentration -
(a) 16 bis 40 Gew.-% Emulgatoren, ausgewählt aus der
Gruppe, die gebildet wird von Anlagerungsprodukten
von 2 bis 30 Mol Ethylenoxid und/oder 0 bis 5 Mol Propy-
lenoxid an lineare und/oder hydroxysubstituierte Fettal-
kohole mit 16 bis 22 C-Atomen,
(b) 5 bis 45 Gew.-% Ölkomponenten sowie
(c) 0 bis 30 Gew.-% Antitranspirant-Wirkstoffe,
mit der Maßgabe, daß sich die Mengenangaben mit Was-
ser und gegebenenfalls weiteren Hilfs- und Zusatzstoffen
zu 100 Gew.-% ergänzen und die Emulsionen transparent
sind.

DE 199 56 185 A 1

Beschreibung

Gebiet der Erfindung

- 5 Die Erfindung befindet transparente Emulsionen mit definierten Mengen an linearen und/oder hydroxysubstituierten Fettalkoholethoxylaten und Ölkomponenten sowie gegebenenfalls Antitranspirant-Wirkstoffen.

Stand der Technik

- 10 Zur Herstellung kosmetischer und/oder pharmazeutischer Mittel werden neben Ölkörpern in vielen Fällen auch nichtionische Emulgatoren, wie beispielsweise Anlagerungsprodukte von Ethylenoxid an Cetearylalkohol oder Behenylalkohol eingesetzt. Wie aus der deutschen Patentanmeldung DE 196 22 613 A1 hervorgeht, sind derartige Emulsionen zwar bei Raumtemperatur stabil, weisen jedoch relativ geringe Viskositäten und darüber hinaus unzureichende Lagerstabilitäten auf. Ein weiterer Nachteil besteht zudem darin, daß Antitranspirant-Zubereitungen mit derartigen Emulgatoren in der
 15 Regel keine guten sensorischen Eigenschaften aufweisen und deren Anwendung deutliche Rückstände auf den aufgetragenen Hautpartien hinterlassen.

- Demzufolge hat die Aufgabe der vorliegenden Erfindung darin bestanden, Emulsionen zur Verfügung zu stellen, die transparent bzw. klar sind und gleichzeitig höhere Viskositäten im Vergleich zu den Produkten aus dem Stand der Technik aufweisen. Darüber hinaus sollten derartige Emulsionen über verbesserte Lagerstabilitäten verfügen. Die Anwendung von Antitranspirant-Zubereitungen mit derartigen Emulsionen zeigen weiterhin gute sensorische Effekte, wie beispielsweise geringere Klebrigkeit und verminderte Rückstände auf den aufgetragenen Hautpartien.

Beschreibung der Erfindung

- 25 Gegenstand der Erfindung sind Emulsionen, enthaltend – bezogen auf die Endkonzentration –

- (a) 16 bis 40 Gew.-% Emulgatoren ausgewählt aus der Gruppe, die gebildet wird von Anlagerungsprodukten von 2 bis 30 Mol Ethylenoxid und/oder 0 bis 5 Mol Propylenoxid an lineare und/oder hydroxysubstituierte Fettalkohole mit 16 bis 22 C-Atomen,
 30 (b) 5 bis 45 Gew.-% Ölkomponenten sowie
 (c) 0 bis 30 Gew.-% Antitranspirant-Wirkstoffe

mit der Maßgabe, daß sich die Mengenangaben mit Wasser und gegebenenfalls weiteren Hilfs- und Zusatzstoffen zu 100 Gew.-% ergänzen und die Emulsionen transparent sind.

- 35 Überraschenderweise wurde gefunden, daß eine definierte Zusammensetzung aus linearen und/oder hydroxysubstituierten Fettalkoholethoxylaten in Kombination mit Ölkomponenten transparente und hochviskose Emulsionen liefern, die über ausgezeichnete Lagerstabilitäten verfügen. Die Verwendung von Behenyl-, Hydroxystearyl- und/oder Cetylstearylthoxylaten führt zu transparenten Systeme mit besonders hohen Viskositäten. Antitranspirant-Zubereitungen mit derartigen Emulsionen weisen gute sensorische Eigenschaften auf und zeigen bei der Anwendung eine geringere Klebrigkeit und deutlich verminderte Rückstände auf den aufgetragenen Hautpartien.
 40

Emulgatoren

- Als Emulgatoren, welche die Komponente (a) bilden, kommen nichtionogene Tenside wie beispielsweise Anlagerungsprodukte von 2 bis 30 Mol Ethylenoxid und/oder 0 bis 5 Mol Propylenoxid an lineare und/oder hydroxysubstituierte Fettalkohole mit 8 bis 22, vorzugsweise 14 bis 20 und vorzugsweise 16 bis 18 C-Atomen in Frage. Typische Beispiele für Fettalkohole sind Caprylalkohol, 2-Ethylhexylalkohol, Caprinalkohol, Laurylalkohol, Isotridecylalkohol, Myristylalkohol, Cetylalkohol, Palmoleylalkohol, Stearylalkohol, Isostearylalkohol, Oleylalkohol, Elaidylalkohol, Petroselinylalkohol, Linolylalkohol, Linolenylalkohol, Elaeostearylalkohol, Arachylalkohol, Gadoleylalkohol, Behenylalkohol,
 50 Erucylalkohol und Brassidylalkohol sowie deren hydroxysubstituierte Derivate. Vorzugsweise werden Emulgatoren der Formel (I) eingesetzt,



- 55 in der R^1 für einen Behenyl-, einen Hydroxystearyl- und/oder einen Cetylstearylrest und vorzugsweise für einen Behenyl- und/oder einen Hydroxystearylrest und n für Zahlen von 2 bis 30, vorzugsweise 10 bis 25 und insbesondere 16 bis 22 steht.

Ölkomponenten

- 60 Als Ölkomponenten, welche die Komponente (b) bilden, kommen beispielsweise Guerbetalkohole auf Basis von Fettalkoholen mit 6 bis 18, vorzugsweise 8 bis 10 Kohlenstoffatomen, Ester von verzweigten C_6 - C_{13} -Carbonsäuren mit linearen C_6 - C_{22} -Fettalkoholen, Ester von linearen C_6 - C_{22} -Fettsäuren mit verzweigten Alkoholen, insbesondere 2-Ethylhexanol, Ester von Hydroxycarbonsäuren mit linearen oder verzweigten C_6 - C_{22} -Fettalkoholen, insbesondere Dioctyl Malate,
 65 Ester von linearen und/oder verzweigten Fettsäuren mit mehrwertigen Alkoholen (wie z. B. Propylenglycol, Dimerdiol oder Trimertriol) und/oder Guerbetalkoholen, flüssige Mono-/Di-/Triglyceridmischungen auf Basis von C_6 - C_{18} -Fettsäuren, Ester von C_6 - C_{22} -Fettalkoholen und/oder Guerbetalkoholen mit aromatischen Carbonsäuren, insbesondere Benzoesäure, Ester von C_2 - C_{12} -Dicarbonsäuren mit linearen oder verzweigten Alkoholen mit 1 bis 22 Kohlenstoffatomen oder

Polyolen mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und 2 bis 6 Hydroxylgruppen, verzweigte primäre Alkohole, substituierte Cyclohexane, lineare und verzweigte C₆-C₂₂-Fettalkoholcarbonate, Guercetcarbonate, Ester der Benzoesäure mit linearen und/oder verzweigten C₆-C₂₂-Alkoholen (z. B. Finsolv® TN), lineare oder verzweigte, symmetrische oder unsymmetrische Dialkylether mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen pro Alkylgruppe, Ringöffnungsprodukte von epoxidierten Fettsäureestern mit Polyolen in Betracht.

Als Ölkomponenten eignen sich weiterhin Siliconverbindungen, wie beispielsweise Dimethylpolysiloxane, Methylphenylpolysiloxane, cyclische Silicone sowie amino-, fettsäure-, alkohol-, polyether-, epoxy-, fluor-, glykosid- und/oder alkylmodifizierte Siliconverbindungen, die bei Raumtemperatur sowohl flüssig als auch harzförmig vorliegen können. Weiterhin geeignet sind Dimethicone, bei denen es sich um Mischungen aus Dimethiconen mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 300 Dimethylsiloxan-Einheiten und hydrierten Silicaten handelt. Eine detaillierte Übersicht über geeignete flüchtige Silicone findet sich zudem von Todd et al. in Cosm.Toil. 91, 27 (1976).

Antitranspirantien

Antitranspirantien (Antiperspirantien), welche gegebenenfalls als Komponente (c) den erfindungsgemäßen Mitteln zugesetzt werden können, reduzieren durch Beeinflussung der Aktivität der ekkrinen Schweißdrüsen die Schweißbildung, und wirken somit Achselnässe und Körpergeruch entgegen. Als Antitranspirant-Wirkstoffe eignen sich vor allem Salze des Aluminiums, Zirkoniums oder des Zinks. Solche geeigneten antihydrotisch wirksamen Wirkstoffe sind z. B. Aluminiumchlorid, Aluminiumchlorhydrat, Aluminiumdichlorhydrat, Aluminiumsesquichlorhydrat und deren Komplexverbindungen z. B. mit Propylenglycol-1,2, Aluminiumhydroxyallantoinat, Aluminiumchloridtartrat, Aluminium-Zirkonium-Trichlorhydrat, Aluminium-Zirkonium-Tetrachlorhydrat, Aluminium-Zirkonium-Pentachlorhydrat und deren Komplexverbindungen z. B. mit Aminosäuren wie Glycin.

Aluminiumchlorhydrate sind farblose, hygroskopische Kristalle, die an der Luft leicht zerfließen und beim Eindampfen wäßriger Aluminiumchloridlösungen. Aluminiumchlorhydrat wird zur Herstellung von schweißhemmenden und desodorierenden Zubereitungen eingesetzt und wirkt wahrscheinlich über den partiellen Verschluß der Schweißdrüsen durch Eiweiß- und/oder Polysaccharidfällung [vgl. J. Soc. Cosm.Chem. 24, 281 (1973)]. Unter der Marke Locron® der Hoechst AG, Frankfurt/FRG, befindet sich beispielsweise ein Aluminiumchlorhydrat im Handel, das der Formel $[Al_2(OH)_5Cl] \cdot 2,5 H_2O$ entspricht und dessen Einsatz besonders bevorzugt ist [vgl. J. Pharm. Pharmacol. 26, 531 (1975)]. Neben den Chlorhydraten können ebenfalls vorzugsweise Aluminiumhydroxylactate sowie saure Aluminium/Zirkoniumsalze, wie beispielsweise Aluminium-Zirkonium Tetrachlorohydrex (Rezal® G36 P) eingesetzt werden. Als weitere Deowirkstoffe können Esteraseinhibitoren zugesetzt werden. Hierbei handelt es sich vorzugsweise um Trialkylcitrate wie Trimethylcitrat, Tripropylcitrat, Triisopropylcitrat, Tributylcitrat und insbesondere Triethylcitrat (Hydagen® CAT, Cognis, Düsseldorf/FRG). Die Stoffe inhibieren die Enzymaktivität und reduzieren dadurch die Geruchsbildung. Wahrscheinlich wird dabei durch die Spaltung des Citronensäureesters die freie Säure freigesetzt, die den pH-Wert auf der Haut soweit absenkt, daß dadurch die Enzyme inhibiert werden. Weitere Stoffe, die als Esteraseinhibitoren in Betracht kommen, sind Sterolsulfate oder -phosphate, wie beispielsweise Lanosterin-, Cholesterin-, Campesterin-, Stigmasterin- und Sitosterinsulfat bzw. -phosphat, Dicarbonsäuren und deren Ester, wie beispielsweise Glutarsäure, Glutarsäuremonoethylester, Glutarsäurediethylester, Adipinsäure, Adipinsäuremonoethylester, Adipinsäurediethylester, Malonsäure und Malonsäurediethylester, Hydroxycarbonsäuren und deren Ester wie beispielsweise Citronensäure, Äpfelsäure, Weinsäure oder Weinsäurediethylester. Antibakterielle Wirkstoffe, die die Keimflora beeinflussen und schweißzersetzende Bakterien abtöten bzw. in ihrem Wachstum hemmen, können ebenfalls in den Stütz Zubereitungen enthalten sein. Beispiele hierfür sind Chitosan, Phenoxylethanol und Chlorhexidylgluconat. Besonders wirkungsvoll hat sich auch 5-Chlor-2-(2,4-dichlorphen-oxy)-phenol erwiesen, das unter der Marke Irgasan® von der Ciba-Geigy, Basel/CH vertrieben wird. Die erfindungsgemäßen Emulsionen können die Antitranspirantien in Mengen in 0 bis 30, vorzugsweise 1 bis 20 und insbesondere 10 bis 15 Gew.-% – bezogen auf die Endkonzentration – enthalten.

Verdickungsmittel

Die erfindungsgemäßen Emulsionen können weiterhin Verdickungsmittel enthalten, wie beispielsweise Aerosil-Typen (hydrophile Kieselsäuren), Polysaccharide, insbesondere Xanthan-Gum, Guar-Guar, Agar-Agar, Alginate und Tylosen, Carboxymethylcellulose und Hydroxyethylcellulose, ferner höhermolekulare Polyethylenglycolmono- und -diester von Fettsäuren, Polyacrylate, (z. B. Carbopole® von Goodrich oder Synthalene® von Sigma), Polyacrylamide, Polyvinylalkohol, Polyurethane und Polyvinylpyrrolidon, Tenside wie beispielsweise ethoxylierte Fettsäureglyceride, Ester von Fettsäuren mit Polyolen wie beispielsweise Pentaerythrit oder Trimethylolpropan, Fettalkoholethoxylate mit eingegengter Homologenverteilung oder Alkyloligoglucoside sowie Elektrolyte wie Kochsalz und Ammoniumchlorid. Weiterhin können als Verdickungsmittel ebenfalls Konsistenzgeber, Polymere und/oder Wachse zugesetzt werden.

Als Konsistenzgeber kommen in erster Linie Fettalkohole oder Hydroxyfettalkohole mit 12 bis 22 und vorzugsweise 16 bis 18 Kohlenstoffatomen und daneben Partialglyceride, Fettsäuren oder Hydroxyfettsäuren in Betracht. Bevorzugt ist eine Kombination dieser Stoffe mit Alkyloligoglucosiden und/oder Fettsäure-N-methylglucamiden gleicher Kettenlänge und/oder Polyglycerinpoly-12-hydroxystearaten. Geeignete kationische Polymere sind beispielsweise kationische Cellulosederivate, wie z. B. eine quaternierte Hydroxyethylcellulose, die unter der Bezeichnung Polymer JR 400® von Amerchol erhältlich ist, kationische Stärke, Copolymere von Diallylammoniumsalzen und Acrylamiden, quaternierte Vinylpyrrolidon/Vinylimidazol-Polymere, wie z. B. Luviquat® (BASF), Kondensationsprodukte von Polyglycolen und Aminen, quaternierte Kollagenpolypeptide, wie beispielsweise Lauryldimonium hydroxypropyl hydrolyzed collagen (Lamequat®/Grünau), quaternierte Weizenpolypeptide, Polyethylenimin, kationische Siliconpolymere, wie z. B. Amidomethicone, Copolymere der Adipinsäure und Dimethylaminohydroxypropyldiethylentriamin (Cartaretine®/Sandoz), Copolymere der Acrylsäure mit Dimethyldialfyllammoniumchlorid (Merquat® 550/Chemvion), Polyaminopolyamide, wie z. B. beschrieben in der FR 2252840 A sowie deren vernetzte wasserlöslichen Polymere, kationische Chitinderivate

wie beispielsweise quaterniertes Chitosan, gegebenenfalls mikrokristallin verteilt, Kondensationsprodukte aus Dihalo-
genalkylen, wie z. B. Dibrombutan mit Bisdialkylaminen, wie z. B. Bis-Dimethylamino-1,3-propan, kationischer Guar-
Gum, wie z. B. Jaguar® CBS, Jaguar® C-17, Jaguar® C-16 der Firma Celanese, quaternierte Ammoniumsalz-Polymere,
wie z. B. Mirapol® A-15, Mirapol® AD-1, Mirapol® AZ-1 der Firma Miranol.

- 5 Als anionische, zwitterionische, amphotere und nichtionische Polymere kommen beispielsweise Vinylacetat/Croton-
säure-Copolymere, Vinylpyrrolidon/Ninylacrylat-Copolymere, Vinylacetat/Butylmaleat/ Isobornylacrylat-Copolymere,
Methylvinylether/Maleinsäureanhydrid-Copolymere und deren Ester, unvernetzte und mit Polyolen vernetzte Polyacryl-
säuren, Acrylamidopropyltrimethylammoniumchlorid/Acrylat-Copolymere, Octylacrylamid/Methylmethacrylat/
tert. Butylaminoethylmethacrylat/2-Hydroxypropylmethacrylat-Copolymere, Polyvinylpyrrolidon, Vinylpyrrolidon/Vi-
10 nylacetat-Copolymere, Vinylpyrrolidon/Dimethylaminoethylmethacrylat/Vinylcaprolactam-Terpolymere sowie gegebe-
nenfalls derivatisierte Celluloseether und Silicone in Frage.

Typische Beispiele für Fette sind Glyceride, als Wachse kommen u. a. Bienenwachs, Carnaubawachs, Candelilla-
wachs, Montanwachs, Paraffinwachs, hydriertes Ricinusöl, bei Raumtemperatur feste Fettsäureester oder Mikrowachse
gegebenenfalls in Kombination mit hydrophilen Wachsen, z. B. Cetylstearylalkohol oder Partialglyceriden in Frage.

- 15 Die Verdickungsmittel können in Mengen in 0 bis 10, vorzugsweise 0,1 bis 6 Gew.-% – bezogen auf die Endkonzent-
ration – zugesetzt werden.

Gewerbliche Anwendbarkeit

- 20 In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung enthalten die Emulsionen – bezogen auf die Endkonzentration
–:

- (a) 20 bis 30 Gew.-% Emulgatoren ausgewählt aus der Gruppe, die gebildet wird von Anlagerungsprodukten von 2
bis 30 Mol Ethylenoxid und/oder 0 bis 5 Mol Propylenoxid an lineare und/oder hydroxysubstituierte Fettalkohole
25 mit 16 bis 22 C-Atomen,
(b) 15 bis 30 Gew.-% Ölkomponenten sowie
(c) 1 bis 20 Gew.-% Antitranspirant-Wirkstoffe

- mit der Maßgabe, daß sich die Mengenangaben mit Wasser und gegebenenfalls weiteren Hilfs- und Zusatzstoffen zu
30 100 Gew.-% ergänzen und die Emulsionen transparent bzw. klar sind.

- Die Viskositäten derartiger Systeme liegen oberhalb von 10000, vorzugsweise 100000, besonders bevorzugt 200000
und insbesondere 500000 mPas (nach Brookfield, 23°C, Spindel TF, 4 Upm). Die Verwendung von Mischungen Behe-
nyl-, Hydroxystearyl- und/oder Cetylstearylthoxylaten können transparente Systeme mit Viskositäten oberhalb von
500000, vorzugsweise 1000000 und insbesondere 2000000 mPas (nach Brookfield, 23°C, Spindel TF, 4 Upm) aufwei-
35 sen.

- Ein weiteren Gegenstand der Erfindung betrifft daher die Verwendung der erfindungsgemäßen Zubereitungen zur Her-
stellung transparenter Zubereitungen mit Viskositäten oberhalb von 10000, vorzugsweise 100000, besonders bevorzugt
200000 und insbesondere 500000 mPas (nach Brookfield, 23°C, Spindel TF, 4 Upm).

40 Weitere Hilfs- und Zusatzstoffe

- Die erfindungsgemäßen Emulsionen können ferner als weitere Hilfs- und Zusatzstoffe milde tenside, weitere Emulga-
toren, Überfettungsmittel, Perlglanzwachse, Konsistenzgeber, Stabilisatoren, biogene Wirkstoffe, Antischuppenmittel,
Filmbildner, Quellmittel, weitere UV-Lichtschutzfaktoren, Antioxidantien, Hydrotrope, Konservierungsmittel, Insekten-
45 repellentien, Selbstbräuner, Solubilisatoren, Parfümöle, Farbstoffe, keimhemmende Mittel und dergleichen enthalten.

- Typische Beispiele für geeignete milde, d. h. besonders hautverträgliche Tenside sind Fettalkoholpolyglycolethersul-
fate, Monoglyceridsulfate, Mono- und/oder Dialkylsulfosuccinate, Fettsäureisethionate, Fettsäuresarcosinate, Fettsäure-
tauride, Fettsäureglutamate, α -Olefin sulfonate, Ethercarbonsäuren, Alkyloligoglycoside, Fettsäureglucamide, Alkylami-
dobetaine und/oder Proteinfettsäurekondensate, letztere vorzugsweise auf Basis von Weizenproteinen.

- 50 Als weitere Emulgatoren kommen beispielsweise nichtionogene Tenside aus mindestens einer der folgenden Gruppen
in Frage:

- (1) C_{12/18}-Fettsäuremono- und -diester von Anlagerungsprodukten von 1 bis 30 Mol Ethylenoxid an Glycerin;
(2) Sorbitanmono- und -diester von gesättigten und ungesättigten Fettsäuren mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen und
55 deren Ethylenoxidanlagerungsprodukte;
(3) Alkylmono- und -oligoglycoside mit 8 bis 22 Kohlenstoffatomen im Alkylrest und deren ethoxylierte Analoga;
(4) Polyglycerinester, wie z. B. Polyglycerinpolyricinoleat, Polyglycerinpoly-12-hydroxystearat oder Polyglyce-
rindimeratostearat. Ebenfalls geeignet sind Gemische von Verbindungen aus mehreren dieser Substanzklassen;
(5) Partialester auf Basis linearer, verzweigter, ungesättigter bzw. gesättigter C_{6/22}-Fettsäuren, Ricinolsäure sowie
60 12-Hydroxystearinsäure und Glycerin, Polyglycerin, Zuckeralkohole (z. B. Sorbit), Alkylglucoside (z. B. Methyl-
glucosid, Butylglucosid, Laurylglucosid) sowie Polyglucoside (z. B. Cellulose);
(6) Mono-, Di- und Trialkylphosphate sowie Mono-, Di- und/oder Tri-PEG-alkylphosphate und deren Salze;
(7) Wollwachsalkohole;
(8) Polyalkylenglycole sowie
65 (9) Glycerincarbonat.

Die Anlagerungsprodukte von Ethylenoxid und/oder von Propylenoxid an Fettsäuren, Alkylphenole, Glycerinmono-
und -diester sowie Sorbitanmono- und -diester von Fettsäuren oder an Ricinusöl stellen bekannte, im Handel erhältliche

Produkte dar. Es handelt sich dabei um Homologengemische, deren mittlerer Alkoxyierungsgrad dem Verhältnis der Stoffmengen von Ethylenoxid und/oder Propylenoxid und Substrat, mit denen die Anlagerungsreaktion durchgeführt wird, entspricht. Civia-Fettsäuremono- und -diester von Anlagerungsprodukten von Ethylenoxid an Glycerin sind aus DE 20 24 051 PS als Rückfettungsmittel für kosmetische Zubereitungen bekannt.

C_{8/18}-Alkylmono- und -oligoglycoside, ihre Herstellung und ihre Verwendung sind aus dem Stand der Technik bekannt. Ihre Herstellung erfolgt insbesondere durch Umsetzung von Glucose oder Oligosacchariden mit primären Alkoholen mit 8 bis 18 C-Atomen. Bezüglich des Glycosidrestes gilt, daß sowohl Monoglycoside, bei denen ein cyclischer Zuckerrest glycosidisch an den Fettalkohol gebunden ist, als auch oligomere Glycoside mit einem Oligomerisationsgrad bis vorzugsweise etwa 8 geeignet sind. Der Oligomerisierungsgrad ist dabei ein statistischer Mittelwert, dem eine für solche technischen Produkte übliche Homologenverteilung zugrunde liegt.

Weiterhin können als Emulgatoren zwitterionische Tenside verwendet werden. Als zwitterionische Tenside werden solche oberflächenaktiven Verbindungen bezeichnet, die im Molekül mindestens eine quartäre Ammoniumgruppe und mindestens eine Carboxylat- und eine Sulfonatgruppe tragen. Besonders geeignete zwitterionische Tenside sind die sogenannten Betaine wie die N-Alkyl-N,N-dimethylammoniumglycinate, beispielsweise das Kokosalkyldimethylammoniumglycinat, N-Acylaminopropyl-N,N-dimethylammoniumglycinate, beispielsweise das Kokosacylaminopropyl dimethylammoniumglycinat, und 2-Alkyl-3-carboxymethyl-3-hydroxyethylimidazoline mit jeweils 8 bis 18 C-Atomen in der Alkyl- oder Acylgruppe sowie das Kokosacylaminoethylhydroxyethylcarboxymethylglycinat. Besonders bevorzugt ist das unter der CTFA-Bezeichnung Cocamidopropyl Betaine bekannte Fettsäureamid-Derivat. Ebenfalls geeignete Emulgatoren sind ampholytische Tenside. Unter ampholytischen Tensiden werden solche oberflächenaktiven Verbindungen verstanden, die außer einer C_{8/18}-Alkyl- oder -Acylgruppe im Molekül mindestens eine freie Aminogruppe und mindestens eine -COOH- oder -SO₃H-Gruppe enthalten und zur Ausbildung innerer Salze befähigt sind. Beispiele für geeignete ampholytische Tenside sind N-Alkylglycine, N-Alkylpropionsäuren, N-Alkylaminobuttersäuren, N-Alkyliminodipropionsäuren, N-Hydroxyethyl-N-alkylamidopropylglycine, N-Alkylaurine, N-Alkylsarcosine, 2-Alkylaminopropionsäuren und Alkylaminoessigsäuren mit jeweils etwa 8 bis 18 C-Atomen in der Alkylgruppe. Besonders bevorzugte ampholytische Tenside sind das N-Kokosalkylaminopropionat, das Kokosacylaminoethylaminopropionat und das C_{12/18}-Acylsarcosin. Neben den ampholytischen kommen auch Kationtenside als Emulgatoren in Betracht, wobei solche vom Typ der Esterquats, vorzugsweise methylquaternierte Difettsäuretriethanolaminester-Salze, besonders bevorzugt sind.

Als Überfettungsmittel können Substanzen wie beispielsweise Lanolin und Lecithin sowie polyethoxylierte oder acylierte Lanolin- und Lecithinderivate, Polyolfettsäureester, Monoglyceride und Fettsäurealkanolamide verwendet werden, wobei die letzteren gleichzeitig als Schaumstabilisatoren dienen.

Als Perlglanzwachse kommen beispielsweise in Frage: Alkylenglycolester, speziell Ethylenglycoldistearat; Fettsäurealkanolamide, speziell Kokosfettsäurediethanolamid; Partialglyceride, speziell Stearinsäuremonoglycerid; Ester von mehrwertigen, gegebenenfalls hydroxysubstituierte Carbonsäuren mit Fettalkoholen mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen, speziell langkettige Ester der Weinsäure; Fettstoffe, wie beispielsweise Fettalkohole, Fettketone, Fettaldehyde, Fettether und Fettcarbonate, die in Summe mindestens 24 Kohlenstoffatome aufweisen, speziell Lauron und Distearylether; Fettsäuren wie Stearinsäure, Hydroxystearinsäure oder Behensäure, Ringöffnungsprodukte von Olefinepoxiden mit 12 bis 22 Kohlenstoffatomen mit Fettalkoholen mit 12 bis 22 Kohlenstoffatomen und/oder Polyolen mit 2 bis 15 Kohlenstoffatomen und 2 bis 10 Hydroxylgruppen sowie deren Mischungen. Denkbar sind hierbei ebenfalls Perlglanzwachse mit optischen Effekten, die durch Pigmente hervorgerufen werden.

Als Stabilisatoren können Metallsalze von Fettsäuren, wie z. B. Magnesium-, Aluminium- und/oder Zinkstearat bzw. -ricinoleat eingesetzt werden.

Unter biogenen Wirkstoffen sind beispielsweise Tocopherol, Tocopherolacetat, Tocopherolpalmitat, Ascorbinsäure, Desoxyribonucleinsäure, Retinol, Bisabolol, Allantoin, Phytantriol, Panthenol, AHA-Säuren, Aminosäuren, Ceramide, Pseudoceramide, essentielle Öle, Pflanzenextrakte und Vitaminkomplexe zu verstehen.

Als Antischuppenmittel können Climbazol, Octopirox und Zinkpyrethion eingesetzt werden. Gebräuchliche Filmbildner sind beispielsweise Chitosan, mikrokristallines Chitosan, quaterniertes Chitosan, Polyvinylpyrrolidon, Vinylpyrrolidon-Vinylacetat-Copolymerisate, Polymere der Acrylsäurereihe, quaternäre Cellulose-Derivate, Kollagen, Hyaluronsäure bzw. deren Salze und ähnliche Verbindungen. Als Quellmittel für wäßrige Phasen können Montmorillonite, Clay Mineralstoffe, Pemulen sowie alkylmodifizierte Carbopoltypen (Goodrich) dienen. Weitere geeignete Polymere bzw. Quellmittel können der Übersicht von R. Lochhead in Cosm. Toil. 108, 95 (1993) entnommen werden.

Unter UV-Lichtschutzfaktoren sind beispielsweise bei Raumtemperatur flüssig oder kristallin vorliegende organische Substanzen (Lichtschutzfilter) zu verstehen, die in der Lage sind, ultraviolette Strahlen zu absorbieren und die aufgenommene Energie in Form längerwelliger Strahlung, z. B. Wärme wieder abzugeben. UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z. B. zu nennen:

- 4-Aminobenzoessäurederivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)benzoessäure-2-ethylhexylester, 4-(Dimethylamino)benzoessäure-2-octylester und 4-(Dimethylamino)benzoessäureamylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure-2-ethylhexylester, Salicylsäure-4-isopropylbenzylester, Salicylsäurehomomenthylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzmalonsäuredi-2-ethylhexylester;
- Triazinderivate, wie z. B. 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin und Octyl Triazon, wie in der EP 0818450 A1 beschrieben;
- Propan-1,3-dione, wie z. B. 1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4-methoxyphenyl)propan-1,3-dion;
- Ketotricyclo(5.2.1.0)decan-Derivate, wie in der EP 0694521 B1 beschrieben.

Als wasserlösliche Substanzen kommen in Frage:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Alkali-, Erdalkali-, Ammonium-, Alkylammonium-, Alkanolammonium- und Glucammoniumsalze;
- 5 - Sulfonsäurederivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäurederivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure und 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornyliden)sulfonsäure und deren Salze.

- 10 Neben den beiden vorgenannten Gruppen primärer Lichtschutzstoffe können auch sekundäre Lichtschutzmittel vom Typ der Antioxidantien eingesetzt werden, die die photochemische Reaktionskette unterbrechen, welche ausgelöst wird, wenn UV-Strahlung in die Haut eindringt. Typische Beispiele hierfür sind Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Butioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen ver-
 15 träglichsten Dosierungen (z. B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate,
 20 Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Superoxid-Dismutase, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selen-Methionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Zur Verbesserung des Fließverhaltens können ferner Hydrotrope, wie beispielsweise Ethanol, Isopropylalkohol, oder Polyole eingesetzt werden. Polyole, die hier in Betracht kommen, besitzen vorzugsweise 2 bis 15 Kohlenstoffatome und
 35 mindestens zwei Hydroxylgruppen. Die Polyole können noch weitere funktionelle Gruppen, insbesondere Aminogruppen, enthalten bzw. mit Stickstoff modifiziert sein. Typische Beispiele sind

- Glycerin;
- Alkylenglycole, wie beispielsweise Ethylenglycol, Diethylenglycol, Propylenglycol, Butylenglycol, Hexylen-
 40 glycol sowie Polyethylenglycole mit einem durchschnittlichen Molekulargewicht von 100 bis 1.000 Dalton;
- technische Oligoglyceringemische mit einem Eigenkondensationsgrad von 1,5 bis 10 wie etwa technische Diglyceringemische mit einem Diglyceringehalt von 40 bis 50 Gew.-%;
- Methyolverbindungen, wie insbesondere Trimethylolethan, Trimethylolpropan, Trimethylolbutan, Pentaerythrit und Dipentaerythrit;
- 45 - Niedrigalkylglucoside, insbesondere solche mit 1 bis 8 Kohlenstoffen im Alkylrest, wie beispielsweise Methyl- und Butylglucosid;
- Zuckeralkohole mit 5 bis 12 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Sorbit oder Mannit,
- Zucker mit 5 bis 12 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Glucose oder Saccharose;
- Aminozucker, wie beispielsweise Glucamin;
- 50 - Dialkoholamine, wie Diethanolamin oder 2-Amino-1,3-propandiol.

Als Konservierungsmittel eignen sich beispielsweise Phenoxyethanol, Formaldehydlösung, Parabene, Pentandiol oder Sorbinsäure sowie die in Anlage 6, Teil A und B der Kosmetikverordnung aufgeführten weiteren Stoffklassen. Als Insekten-Repellentien kommen N,N-Diethyl-m-toluamid, 1,2-Pentandiol oder Insekten-Repellent 3535 in Frage, als
 55 Selbstbräuner eignet sich Dihydroxyacetone.

Als Parfümöle seien genannt Gemische aus natürlichen und synthetischen Riechstoffen. Natürliche Riechstoffe sind Extrakte von Blüten (Lilie, Lavendel, Rosen, Jasmin, Neroli, Ylang-Ylang), Stengeln und Blättern (Geranium, Patchouli, Petitgrain), Früchten (Anis, Koriander, Kümmel, Wacholder), Fruchtschalen (Bergamotte, Zitronen, Orangen), Wurzeln (Macis, Angelica, Sellerie, Kardamon, Costus, Iris, Calmus), Hölzern (Pinien-, Sandel-, Guajak-, Zedern-, Rosenholz),
 60 Kräutern und Gräsern (Estragon, Lemongras, Salbei, Thymian), Nadeln und Zweigen (Fichte, Tanne, Kiefer, Latschen), Harzen und Balsamen (Galbanum, Elemi, Benzoe, Myrrhe, Olibanum, Opoponax). Weiterhin kommen tierische Rohstoffe in Frage, wie beispielsweise Zibet und Castoreum. Typische synthetische Riechstoffverbindungen sind Produkte vom Typ der Ester, Ether, Aldehyde, Ketone, Alkohole und Kohlenwasserstoffe. Riechstoffverbindungen vom Typ der Ester sind z. B. Benzylacetat, Phenoxyethylisobutyrat, p-tert.-Butylcyclohexylacetat, Linalylacetat, Dimethylbenzylcarbinylacetat, Phenylethylacetat, Linalylbenzoat, Benzylformiat, Ethylmethylphenylglycinat, Allylcyclohexylpropionat, Styrallylpropionat und Benzylsalicylat. Zu den Ethern zählen beispielsweise Benzylethylether, zu den Aldehyden z. B. die linearen Alkanale mit 8 bis 18 Kohlenstoffatomen, Citral, Citronellal, Citronellyloxyacetaldehyd, Cyclamenaldehyd, Hydroxycitronellal, Lilial und Bourgeonal, zu den Ketonen z. B. die Jonone, α -Isomethylnonon und Methylcedrylketon,

zu den Alkoholen Anethol, Citronellol, Eugenol, Isoeugenol, Geraniol, Linalool, Phenylethylalkohol und Terpeneol, zu den Kohlenwasserstoffen gehören hauptsächlich die Terpene und Balsame. Bevorzugt werden jedoch Mischungen verschiedener Riechstoffe verwendet, die gemeinsam eine ansprechende Duftnote erzeugen. Auch ätherische Öle geringerer Flüchtigkeit, die meist als Aromakomponenten verwendet werden, eignen sich als Parfümöle, z. B. Salbeiöl, Kamillenöl, Nelkenöl, Melissenöl, Minzenöl, Zimtblätteröl, Lindenblütenöl, Wacholderbeerenöl, Vetiveröl, Olibanöl, Galbanumöl, Labolanumöl und Lavandinöl. Vorzugsweise werden Bergamotteöl, Dihydromyrcenol, Lilial, Lyril, Citronellol, Phenylethylalkohol, α -Hexylzimtaldehyd, Geraniol, Benzylaceton, Cyclamenaldehyd, Linalool, Boisambrene Forte, Ambroxan, Indol, Hedione, Sandelice, Citronenöl, Mandarinenöl, Orangenöl, Allylamilglycolat, Cyclovertal, Lavandinöl, Muskateller Salbeiöl, β -Damascone, Geraniumöl Bourbon, Cyclohexylsalicylat, Vertofix Coeur, Iso-E-Super, Fixolide NP, Evernyl, Iraldein gamma, Phenyllessigsäure, Geranylacetat, Benzylacetat, Rosenoxid, Romillat, Irotyl und Floramat allein oder in Mischungen, eingesetzt.

Als Farbstoffe können die für kosmetische Zwecke geeigneten und zugelassenen Substanzen verwendet werden, wie sie beispielsweise in der Publikation "Kosmetische Färbemittel" der Farbstoffkommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft, Verlag Chemie, Weinheim, 1984, S. 81–106 zusammengestellt sind oder Pigmente, Goldfitter und dergleichen eingesetzt werden. Diese Farbstoffe werden üblicherweise in Konzentrationen von 0,001 bis 0,1 Gew.-%, bezogen auf die gesamte Mischung, eingesetzt.

Typische Beispiele für keimhemmende Mittel sind Konservierungsmittel mit spezifischer Wirkung gegen gram-positive Bakterien wie etwa 2,4,4'-Trichlor-2'-hydroxydiphenylether, Chlorhexidin (1,6-Di-(4-chlorphenyl-biguanido)-hexan) oder TCC (3,4,4'-Trichlorcarbonilid). Auch zahlreiche Riechstoffe und etherische Öle weisen antimikrobielle Eigenschaften auf. Typische Beispiele sind die Wirkstoffe Eugenol, Menthol und Thymol in Nelken-, Minz- und Thymianöl. Ein interessantes natürliches Deomittel ist der Terpenalkohol Farnesol (3,7,11-Trimethyl-2,6,10-dodecatrien-1-ol), der im Lindenblütenöl vorhanden ist und einen Maiglöckchengeruch hat. Auch Glycerinmonolaurat hat sich als Bakteriostatikum bewährt. Üblicherweise liegt der Anteil der zusätzlichen keimhemmenden Mittel bei etwa 0,1 bis 2 Gew.-% – bezogen auf den auf den Feststoffanteil der Zubereitungen.

Der Gesamtanteil der Hilfs- und Zusatzstoffe kann 1 bis 50, vorzugsweise 5 bis 40 Gew.-% – bezogen auf die Mittel – betragen.

Beispiele

Es wurden verschieden O/W-Emulsionen mit (Beispiele 1 bis 3) oder ohne (Beispiele 4 und 5) Antitranspirants hergestellt. Die Emulsion V1 mit geringeren Mengen Fettalkoholethoxylaten dient zum Vergleich. Die Viskositäten der Zubereitungen wurden nach der Methode von Brookfield (mPas, 23°C, Spindel TF, 4 Upm) gemessen. Die erfindungsgemäßen Antitranspirant-Emulsionen 1, 4 und 5 zeigen im Vergleich zum Stand der Technik (V1) bei erhöhter Viskosität deutlich geringere Klebrigkeiten sowie verminderte Rückstände bei der Anwendung auf der Haut auf.

Tabelle 1

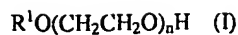
Emulsionen (Mengenangaben in Gew.-%)

| 5 | Zusammensetzung/Performance | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | V1 |
|----|--|---------|---------|---------|---------|--------|-------|
| | | 8 | - | 8 | 8 | 8 | 5 |
| | Eumulgin® B1 Ceteareth-12 | | | | | | |
| 10 | Eumulgin® B2 Ceteareth-20 | - | - | - | - | 15 | 8 |
| | Hydroxystearylalkohol + 33 EO | - | - | 12 | 15 | - | - |
| | Mergital® B 10 Beheneth-10 | - | 4 | - | - | - | - |
| 15 | Mergital® B 25 Beheneth-25 | 12 | 20 | - | - | - | - |
| | Silicon Oil DC 345 Cyclomethicone | 10 | 8 | 10 | 10 | 10 | 10 |
| 20 | Cetiol® OE Dicapryl Ether | 10 | - | - | - | 10 | 10 |
| | Cetiol® CC Dicapryl Ether | - | 7 | 10 | 10 | - | - |
| 25 | Myritol® 331 Cocoglycerides | 5 | 5 | - | 5 | - | 5 |
| | Cetiol® PGL | - | - | 5 | - | 7 | - |
| | Glycerin (86 gew.-%ig) | 10 | 10 | 10 | 10 | 10 | 10 |
| 30 | Glimmerpigment: Timiron Silk Gold* | | | | | | |
| | Aluminiumhydroxychlorid | - | 20 | 25 | - | - | - |
| | Rezal® G 36 P Aluminium Zirconium Tetrachlorohydrat GLY | - | - | - | 15 | 15 | 15 |
| 35 | Wasser | ad 100 | | | | | |
| | Viskosität | | | | | | |
| | 1 Tag | 2000000 | 2500000 | 1725000 | 1600000 | 700000 | 10000 |
| 40 | 2 Wochen | 1900000 | 2400000 | 1700000 | 1580000 | 650000 | 9000 |

*als Glimmerpigmente können ebenfalls Timiron-Typen, Colorona-Typen, Dichrona-Typen der Firma Merck verwendet werden.

Patentansprüche

- 45 1. Emulsionen, enthaltend – bezogen auf die Endkonzentration –
- (a) 16 bis 40 Gew.-% Emulgatoren ausgewählt aus der Gruppe, die gebildet wird von Anlagerungsprodukten von 2 bis 30 Mol Ethylenoxid und/oder 0 bis 5 Mol Propylenoxid an lineare und/oder hydroxysubstituierte Fettalkohole mit 16 bis 22 C-Atomen,
- 50 (b) 5 bis 45 Gew.-% Ölkomponenten sowie
- (c) 0 bis 30 Gew.-% Antitranspirant-Wirkstoffe
- mit der Maßgabe, daß sich die Mengenangaben mit Wasser und gegebenenfalls weiteren Hilfs- und Zusatzstoffen zu 100 Gew.-% ergänzen und die Emulsionen transparent sind.
- 55 2. Emulsionen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Komponente (b) Ölkomponenten enthalten, die ausgewählt sind aus der Gruppe, die gebildet wird von Guerbetalkoholen auf Basis von Fettalkoholen mit 6 bis 18 Kohlenstoffatomen, Estern von verzweigten C₆-C₁₃-Carbonsäuren mit linearen C₆-C₂₂-Fettalkoholen, Estern von linearen C₆-C₂₂-Fettsäuren mit verzweigten Alkoholen, Estern von Hydroxycarbonsäuren mit linearen oder verzweigten C₆-C₂₂-Fettalkoholen, Estern von linearen und/oder verzweigten Fettsäuren mit mehrwertigen Alkoholen und/oder Guerbetalkoholen, flüssigen Mono-/Di-/Triglyceridmischungen auf Basis von C₆-C₁₈-Fettsäuren, Estern von C₆-C₂₂-Fettalkoholen und/oder Guerbetalkoholen mit aromatischen Carbonsäuren, Estern von C₂-C₁₂-Dicarbonsäuren mit linearen oder verzweigten Alkoholen mit 1 bis 22 Kohlenstoffatomen oder Polyolen mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und 2 bis 6 Hydroxylgruppen, verzweigten primären Alkoholen, substituierten Cyclohexanen, linearen und verzweigten C₆-C₂₂-Fettalkoholcarbonaten, Guerbetcarbonaten, Estern der Benzoesäure mit linearen und/oder verzweigten C₆-C₂₂-Alkoholen, linearen oder verzweigten, symmetrischen oder unsymmetrischen Dialkylethern mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen pro Alkylgruppe sowie Ringöffnungsprodukten von epoxidierten Fettsäureestern mit Polyolen.
- 65 3. Emulsionen nach den Ansprüchen 1 und/oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Komponente (a) Emulgatoren der Formel (I) enthalten,



in der R^I für einen Behenyl-, einen Hydroxystearyl- und/oder einen Cetylstearylrest und n für Zahlen von 2 bis 30 steht.

4. Emulsionen nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Komponente (a) Emulgatoren der Formel (I) enthalten, in der R^I für einen Behenylrest steht.
 5. Emulsionen nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Komponente (a) Emulgatoren der Formel (I) enthalten, in der R^I für einen Hydroxystearylrest steht.
 6. Emulsionen nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß sie als Komponente (c) Salze des Aluminiums, Zirkoniums oder des Zinks sowie deren Komplexverbindungen enthalten.
 7. Emulsionen nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß sie weiterhin Verdickungsmittel enthalten.
 8. Emulsionen nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, daß sie eine Viskosität oberhalb von 100000 mPas gemessen nach Brookfield (23°C, Spindel TF, 4 Upm) aufweisen.
 9. Emulsionen, enthaltend – bezogen auf die Endkonzentration –
 - (a) 20 bis 30 Gew.-% Emulgatoren ausgewählt aus der Gruppe, die gebildet wird von Anlagerungsprodukten von 2 bis 30 Mol Ethylenoxid und/oder 0 bis 5 Mol Propylenoxid an lineare und/oder hydroxysubstituierte Fettalkohole mit 16 bis 22 C-Atomen,
 - (b) 15 bis 30 Gew.-% Ölkomponenten sowie gegebenenfalls
 - (c) 1 bis 20 Gew.-% Antitranspirant-Wirkstoffe
- mit der Maßgabe, daß sich die Mengenangaben mit Wasser und ggf. weiteren Hilfs- und Zusatzstoffen zu 100 Gew.-% ergänzen und die Emulsionen transparent sind.
10. Verwendung von Zubereitungen nach Anspruch 1 zur Herstellung transparenter Zubereitungen mit Viskositäten oberhalb von 10000 mPas (nach Brookfield, 23°C, Spindel TF, 4 Upm).

- Leerseite -

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
12 April 2001 (12.04.2001)

PCT

(10) International Publication Number
WO 01/24766 A1

(51) International Patent Classification⁷: **A61K 7/00,**
7/32, 7/34, 7/38

(21) International Application Number: **PCT/EP00/09144**

(22) International Filing Date:
18 September 2000 (18.09.2000)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/157,382 1 October 1999 (01.10.1999) US

(71) Applicant (for AE, AG, AU, BB, BZ, CA, CY, GB, GD, GH, GM, IE, IL, KE, LC, LK, LS, MN, MW, NZ, SD, SG, SL, SZ, TT, TZ, UG, ZA, ZW only): **UNILEVER PLC** [GB/GB]; Unilever House, Blackfriars, London EC4P 4BQ (GB).

(71) Applicant (for all designated States except AE, AG, AU, BB, BZ, CA, CY, GB, GD, GH, GM, IE, IL, IN, KE, LC, LK, LS, MN, MW, NZ, SD, SG, SL, SZ, TT, TZ, UG, ZA, ZW): **UNILEVER NV** [NL/NL]; Weena 455, NL-3013 AL Rotterdam (NL).

(71) Applicant (for IN only): **HINDUSTAN LEVER LIMITED** [IN/IN]; Hindustan Lever House, 165/166 Backbay Reclamation, Maharashtra, 400 020 Mumbai (IN).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): **MA, Zhuning**

[/US]; Unilever Home & Personal Care USA, 3100 East Golf Road, Rolling Meadows, Chicago, IL 60008 (US). **BRUCKS, Richard, Mark** [/US]; Unilever Home & Personal Care USA, 3100 East Golf Road, Rolling Meadows, Chicago, IL 60008 (US).

(74) Agents: **PEARCE, Timothy et al.**; Unilever PLC, Patent Department, Colworth House, Sharnbrook, Bedford, Bedfordshire MK44 1LQ (GB).

(81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

- With international search report.
- Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments.

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: **ANTIPERSPIRANT COMPOSITIONS COMPRISING MICROEMULSIONS**

(57) Abstract: Stable, clear, antiperspirant microemulsions containing cosmetic oils, antiperspirant salts, and water and combinations of cationic quaternary ammonium salt are provided. These microemulsions can be used in different types of applicators such as roll-on, sponge, mousse, pad, brush, gel and aerosol or non-aerosol spray applicators.

WO 01/24766 A1

- 1 -

ANTIPERSPIRANT COMPOSITIONS COMPRISING MICROEMULSIONS5 Field of the Invention

This invention is related to microemulsions that contain cosmetically active ingredients. In a preferred embodiment, this invention is related to antiperspirant
10 salt-containing microemulsions that are stable, clear liquids and are easy and inexpensive to produce.

Background of the Invention

15

The microemulsions of the present invention contain water. Microemulsions of the present invention are transparent or translucent, optically isotropic and thermodynamically stable mixtures of oil and water
20 stabilized by surfactants and perhaps co-surfactants. The particle size of the dispersed phase of a microemulsion is about 100 to about 2000 angstroms, more preferably are about 100 to about 1000 angstroms. They can form spontaneously or with a little energy. Therefore they are simple to prepare
25 and are not process dependent i.e. the order of addition of starting materials or speed / type of mixing is not critical to the preparation of the microemulsions. It would be desirable to formulate antiperspirant compositions using microemulsions because microemulsions are easy and
30 inexpensive to process and can be inherently clear without

- 2 -

requiring refractive index matching of the aqueous and non-aqueous phases.

Microemulsions have attracted considerable
5 technological and scientific interest. Water-in-oil (w/o) microemulsions containing water, an ionic surfactant, a cosurfactant and oil are the most investigated. The ionic surfactant- containing microemulsions usually exhibit stability over a large range of temperature. . When
10 inorganic salts are added, the minimum surfactant level to form water-in-oil microemulsions will increase. As the hydrocarbon oil chain length increases, the solubilization of aqueous phase into the oil phase decreases, while the liquid crystal area increases. Nonionic surfactant-
15 containing water-in-oil microemulsions require a large amount of surfactant as well. Unfortunately, nonionic surfactant-containing microemulsions commonly exhibit a small temperature range of stability

20 Microemulsions exist in the following forms: as water-in-oil, oil-in-water or as a *bicontinuous phase*, which is also called the *surfactant phase*. As used herein, the term "microemulsion means water-in-oil, oil-in-water or a bicontinuous phase, or mixtures thereof. Bicontinuous phase
25 microemulsions are found to solubilize a high amount of water and oil with lower levels of surfactant. The region around a bicontinuous phase microemulsion may transition into a swollen lamellar phase, otherwise known as a liquid crystal phase, and in certain cases these phases
30 (microemulsion and liquid crystal) may co-exist. These phases exhibit birefringence, shear induced (streaming)

- 3 -

birefringence, and are thixotropic, viscoelastic and transparent. Because some of these systems exhibit increased viscosity the technical literature may refer to them as microemulsion gels.

5

It is an object of the present invention to provide antiperspirant compositions, which contain high levels of antiperspirant salts, cosmetic oils and surfactants suitable for application to the axilla. It is also an object of the present invention to provide antiperspirant compositions that do not require refractive index matching of the aqueous and nonaqueous phases in order to be clear. It is also an object of the present invention to provide microemulsion antiperspirant compositions that require little energy to manufacture. These and other objects of the present invention will become more readily apparent in the present application.

Patents and patent documents, which are cited in connection with the disclosed invention, are as follows:

DE 196 42 090 A1 discloses cosmetic or dermatologic compositions based on microemulsions.

U.S. Patent 5,162,378 discloses water in oil microemulsions comprising cetyl dimethicone copolyol, water, silicone, alcohol, and 5-40% by weight of one or more salts.

U.S. Patent 5,705,562 discloses a method of spontaneously forming a highly stable clear microemulsion by combining water, a volatile cyclic methyl siloxane or a

- 4 -

volatile linear methyl siloxane and a silicone polyether surfactant. U.S Patent 5,707,613 is in the same patent family as the just mentioned patent.

5 WO 94/22420 is concerned with silicone-based skin care products, which are applied to the skin as aerosols and form a clear gel on the skin.

10 WO 94/19000 discloses pharmaceutical compositions in the form of a microemulsion which comprise an oil, a mixture of high and low HLB surfactants in which the high HLB surfactant comprises an aliphatic, aryl or aliphatic-aryl sulfate or sulfosuccinate or salt thereof, an aqueous phase and a biologically active agent.

15

WO 94/08610 discloses pharmaceutical compositions in the form of microemulsions which comprise an oil, a mixture of high and low HLB surfactants in which the high HLB surfactant comprises a medium-chain fatty acid salt, an aqueous phase and a biologically active agent.

20

U.S. 5,575,990 discloses roll-on antiperspirant compositions which are clear and, when applied to the human skin, do not leave a visible white residue after drying.

25 The clear antiperspirant roll-on compositions are stable under varying temperature conditions and provide a suitable cosmetically acceptable feel or sensation when applied to the human skin.

30 U.S. 5,487,887 discloses roll-on antiperspirant compositions and more particularly concerns antiperspirant

- 5 -

compositions which are clear and stable under varying temperature conditions and, when applied to the human skin, do not leave a visible white residue after drying. The compositions in the form of an oil-in-water microemulsion, 5 comprise an antiperspirant active 5-30, PEG-7-glyceryl cocoate 5-25, emollients 0.5-3, cyclomethicone 3-7, and water 53-60%.

10 Summary of the Invention

The invention relates to a composition in the form of a microemulsion comprising an antiperspirant salt, a cosmetic oil, and a combination of at least one cationic quaternary 15 surfactant and at least one nonionic surfactant.

Detailed Description of the Invention

20 The present invention is directed to antiperspirant salt-containing microemulsions that are stable and clear liquids, or clear antiperspirant gels.

Stable clear microemulsions containing cosmetic oils, 25 antiperspirant salt, water, quaternary surfactants and nonionic surfactants have been discovered. The microemulsions are primarily composed of bicontinuous phase but the compositions include water-in-oil, oil-in-water, and microemulsion gels (liquid crystals). The microemulsions 30 are novel antiperspirant compositions that can be used in different types of applicators such as roll-on, sponge,

- 6 -

mousse, pad, wipe, brush, gel and aerosol or non-aerosol spray applicators.

5 The microemulsions discovered in this invention contain inorganic salts such as antiperspirant salts and cosmetic oils and the solubilization of high levels of both oil and aqueous solution of salts is achieved by incorporating combinations of a quaternary ammonium surfactant and a nonionic surfactant.

10

More specifically, the invention relates to a composition in the form of a microemulsion comprising an antiperspirant salt, cosmetic oils, and a combination of at least one cationic quaternary surfactant and at least one nonionic surfactant.

15

The invention also relates to a method for controlling or preventing underarm perspiration and malodor, which comprises applying to the underarm area a composition according to the invention.

20

The characteristics of the microemulsions of this invention include one or more of:

- 25 • The microemulsions exhibit stability over a relatively large range of temperature.
- The viscosity ranges from a thick gel to a low viscosity sprayable liquid.
- The types of the microemulsions formed are dependent on the ratio of aqueous phase to the nonionic surfactant(s) and oil. When the percentage of the salt solution

30

- 7 -

containing quaternary surfactant increases, the microemulsion changes from water-in-oil to oil-in-water type, and a bicontinuous microemulsion phase, or possibly a liquid crystal phase, will form in-between.

- 5 • The microemulsions can contain a high level of inorganic salts.
- The microemulsions contain a quaternary surfactant and a nonionic surfactant.
- The microemulsions contain cosmetically acceptable oils.
- 10 • A method for controlling or preventing underarm perspiration and malodor, which can be applied to the underarm area.
- The application of the microemulsions can be accomplished by using various product dispensers.

15

As used herein % means weight percent unless otherwise specified.

As used herein the term cationic surfactant means
20 quaternary ammonium surfactant.

The starting materials set forth herein are either known or can be prepared according to known methods. The compositions of the invention can be made by known methods
25 or by methods that are analogous to known methods.

As used herein, microemulsions mean stable clear microemulsions containing cosmetic oil; antiperspirant salts, water and surfactants. The microemulsions described
30 herein are primarily composed of bicontinuous phase but the